

⑩ 日本国特許庁 (JP)

⑪ 特許出願公開

⑫ 公開特許公報 (A)

昭58—18334

⑤ Int. Cl. <sup>3</sup>	識別記号	庁内整理番号	⑬ 公開 昭和58年(1983)2月2日
C 07 C 59/66		7188—4H	
A 01 N 37/06		6526—4H	発明の数 7
37/10		6526—4H	審査請求 未請求
37/16		6526—4H	
37/18		6526—4H	
37/34		6526—4H	
43/40	1 0 1	7055—4H	
43/42	1 0 1	7055—4H	
C 07 C 69/734		6556—4H ※	(全 13 頁)

⑭ 除草剤及び植物成長調整剤として有用な2,4  
—ヘキサジエン酸誘導体

⑮ 特 願 昭57—118721

⑯ 出 願 昭57(1982)7月9日

優先権主張 ⑰ 1981年7月13日 ⑱ イタリア

(I T) ⑲ 22890 A/81

⑳ 発 明 者 マルコ・フオア

イタリア国ノバラ・ピア・デル  
・サビオネ19

⑪ 出 願 人 モンテデイソン・エツセ・ビ  
ア

イタリア国ミラノ・フオロ・ブ  
オナバルテ31

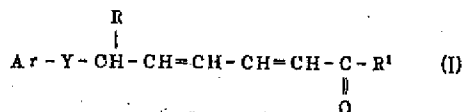
㉑ 代 理 人 弁理士 倉内基弘 外1名  
最終頁に続く

## 明 細 書

1. 発明の名称 除草剤及び植物成長調整剤として  
有用な2,4—ヘキサジエン酸誘導  
体

## 2. 特許請求の範囲

(1) 一般式



( R は水素原子又はメチルであり、Y は酸素又は二価の黄硫原子であり、R<sup>1</sup> は OR<sup>2</sup>、SR<sup>2</sup> 又は N(R<sup>2</sup>)<sub>2</sub> の基であり、R<sup>2</sup> は水素原子、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub> アルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>4</sub> アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>4</sub> アルキニル、フェニル又はベンジルであり、Ar はフェニル、ビリジル、ナフチル、キノリン核、フェノキシフェニル又はビリジルオキシフェニルであり、これら基は必要に応じ水素原子、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub> アル

キル基、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub> アルコキシ基、ニトロ、シアノ、トリフルオロメチル、アセトキシ、アセトアミド及びメトキシカルボニル基から選択される1個又はそれ以上の置換基により置換される )

の化合物。

(2) R<sup>1</sup> は基 OR<sup>2</sup> であり、R<sup>2</sup> は水素原子又はメチルである特許請求の範囲第1項記載の化合物。

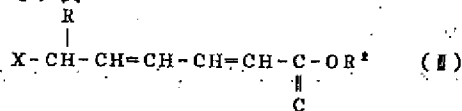
(3) R<sup>1</sup> が基 OR<sup>2</sup> でありかつ R<sup>2</sup> が水素原子又は C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub> アルキルである特許請求の範囲第1項記載の化合物を製造するに際し、式



(式中、M<sup>⊕</sup> はアルカリ金属の陽イオンであり、Ar、及び Y は特許請求の範囲第1項記載と同じ意味を有する )

のアルカリ塩を不活性ガス雰囲気中において、極性溶媒中で室温乃至溶媒の沸点温度の範囲の温度

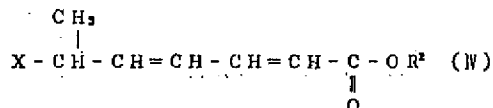
にて、式



〔式中、Xは塩素、臭素又は沃素の原子であり、 $R^2$ は $C_1 \sim C_4$ アルキルであり、Rは水素原子又はメチルである〕

のエステルと反応させ、これにより $R^2$ が $C_1 \sim C_4$ アルキルである式(I)の化合物を得、次いでこれら化合物から加水分解により $R^2$ が水素原子である式(I)の化合物をうることを特徴とする特許請求の範囲第1項記載の化合物の製造方法。

#### (4) 一般式



〔式中、Xは塩素、臭素又は沃素の原子であり、 $R^2$ は $C_1 \sim C_4$ アルキルである〕の化合物。

(5) 保護すべき領域に特許請求の範囲第1項記載の化合物の1種又はそれ以上の有効量をそのまま又は適当な組成物として、発芽前又は発芽後に散布することを特徴とする、単子葉及び双子葉植物の蔓延を防止する方法。

3

活性を備えた6位置が1置換若しくは2置換された2,4-ヘキサジエン酸誘導体に関するものである。

さらに、本発明は重要な耕作物を蔓延植物から保護するためのその使用並びに植物成長調整剤としてのその利用に関するものである。

農業において最も広く使用されている除草剤の1種は2,4-ジクロロフェノキシ酢酸(市販名: 2,4-D)であり、その除草活性は最初にビー・ダブリュー・チンメルマン及びイー・イー・ヒフテロックによりContr. Boyce Thompson Inst. 12, 321(1942)に記載された。

この化合物は、特に発芽後の処理において、優れた除草特性を有する。

しかしながら2,4-Dは極めて雑草性の化合物であり、この特長は重大な欠点を示す。何故なら、この化合物は施用中及び施用後において隣接する耕作物にまで移行して、回復不能にこれらを破壊させるからである。

さらに、2,4-Dの多量の使用はその除草活性に

(6) 活性物質として特許請求の範囲第1項記載の化合物の1種又はそれ以上を1~99重量%の範囲の量で含有する除草用組成物。

(7) 植物又はその部分を特許請求の範囲第1項記載の化合物の1種又はそれ以上の有効量にてそのまま又は適当な組成物として処理することを特徴とする、有葉植物の成長及び根部成長を促進させ又は果実収量を増大させる方法。

(8) 温室におけるトマト又はこしょう栽培物の植付処理に適用する特許請求の範囲第7項記載の方法。

(9) 収穫前における果実の脱落防止処理に適用する特許請求の範囲第7項記載の方法。

(10) 活性物質として特許請求の範囲第1項記載の化合物の1種又はそれ以上を含有する植物成長調整用組成物。

#### 3. 発明の詳細な説明

本発明は新規な除草用ヘキサジエン酸化合物に關し、さらに詳細には除草活性及び植物成長調整

4

耐えうる感染植物の発現を促進してしまふ。

これらの欠点を克服するため多数の化合物が合成されており、その構造は直接的に又は間接的に2,4-ジクロロフェノキシ酢酸の1つから誘導される。

たとえば、ナフトキシ酢酸誘導体(ベルギー特許第774,748号、スタウハー)、フェノキシフェノキシ酢酸誘導体(ベルギー特許第864,632号、チバ・ガイギー社)及びフェノキシフェノキシクロトン酸誘導体(ベルギー特許第871,523号、クミアイイ)を引用することができる。

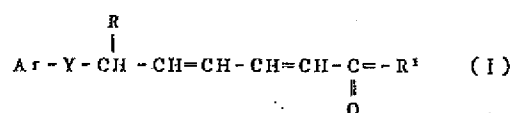
さらに、2,4-ジクロロフェノキシ酢酸は植物成長調整活性を備えるが、その高い植物毒性のため植物成長調整剤としての利用が妨げられる。

今回、或る種の2,4-ヘキサジエン酸誘導体は除草活性を備えると共に、重要な耕作物に対し高度の選択性を有し、さらに植物成長調整活性をも有することが見出された。

したがって、本発明の目的は一般式

5

6



〔Rは水素原子又はメチルであり、Yは酸素原子又は二価の硫黄原子であり、R<sup>1</sup>は基OR<sup>2</sup>、SR<sup>2</sup>又はN(R<sup>2</sup>)<sub>2</sub>であり、R<sup>2</sup>は水素原子、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>4</sub>シクロアルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>4</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>4</sub>アルキニル、フェニル又はベンジルであり、Arはフェニル、ビリジル、ナフチル、キノリン核、フェノキシフェニル又はビリジルオキシフェニルであり、これらの基は必要に応じ、ハロゲン原子、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシシル基、ニトロ、シアノ、トリフルオロメチル、アセトキシ、アセトアミド及びメトキシカルボニル基から選択される1種又はそれ以上の置換基により置換される〕

の化合物を提供することである。

一般式(I)の化合物は除草活性及び植物成長調整活性を有し、かつ農業において有利に使用するこ

7

することにより、式(I)の他の化合物が製造される。たとえば、加水分解によりカルボン酸(R<sup>1</sup>=OH)を製造することができ、これを対応するハロゲン化アシルに変え、かつ適当なアルコール、チオール又はアミンと反応させてR<sup>1</sup>=OR<sup>2</sup>、SR<sup>2</sup>及びN(R<sup>2</sup>)<sub>2</sub>である式(I)の化合物をそれぞれ得ることができる。

塩(II)とエステル(III)との間の縮合は、一般に不活性ガス雰囲気中において極性溶媒中で行なわれる。

窒素乃至溶媒の沸点温度の範囲の温度にて数時間攪拌した後、反応は完結しそして生成物を慣用の実験室技術に従って単離する。

式(II)の化合物は固体又は高沸点を有する液体の形態である。

式(II)のアルカリ塩は一般に公知の化合物であるか、又は慣用技術に従って公知化合物から容易に製造することができる。

また、R=Hである式(II)のエステルも、たとえばエルベチカ・ヒミカ・アクタ第29巻、第1191頁(1946)又はJournal of the Chemical

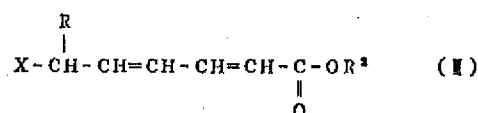
とができる。

その製造は、有機化学の慣行で一般的に使用される技術に従って行なわれる。

有利な合成は式



〔式中、M<sup>⊕</sup>はアルカリ金属の陽イオンであり、Ar及びYは一般式(I)に記載した意味を有する〕のアルカリ塩を、式



〔式中、R<sup>2</sup>は低級アルキルであり、Rは水素原子又はメチルであり、Xは塩素、臭素又は沃素の原子である〕

のアルキルエステルと縮合させることになつて

いる。上記の反応は、R<sup>2</sup>が基OR<sup>2</sup>であり、かつR<sup>2</sup>がアルキルである式(II)の化合物(エステル誘導体)の生成をもたらす。

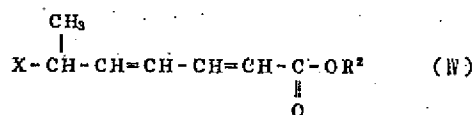
これらの化合物からは、慣用技術に従って操作

8

Society、第866頁(1946)に記載されているように製造しうる公知化合物である。

本出願人の知る限り、R=CH<sub>3</sub>である式(II)の化合物は、新規な化合物である。

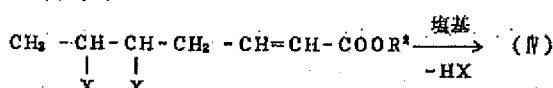
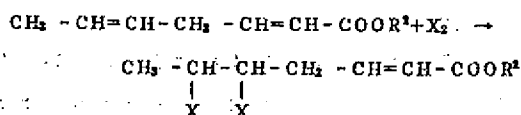
したがって、本発明の他の目的は式



〔式中、Xは塩素、臭素又は沃素の原子であり、R<sup>2</sup>はC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルである〕

の化合物を提供することである。

この種の化合物は、記下の反応式に従って、2,5-ヘプタジエン酸アルキル(これは公知化合物である)のハロゲン化及びデヒドロハロゲン化によつて製造することができる。



式(I)の化合物の製造を、例1に記載する。

上記したように、式(I)の化合物は高度の除草活性を有する。これらの種類において、数種の化合物は双子葉用雑草に対しより効果的な作用を示し、他のものは単子葉雑草に対し効果的な活性を示し、いずれの場合も有用栽培物に対して高度の選択性を保持する。

さらに、これらは発芽前（すなわち、感染植物がまだ土中から出芽していない時期）及び出芽後の両者において活性である。

最良の結果は出芽後の期間に使用して得られる。

除草活性に関し、好適な化合物は、Rが水素原子であり、かつArが置換フェニルであるか、或いはRがメチルでありかつArがフェノキシフェニル又は適時置換されたピリジンオキシフェニルである式(I)の化合物である。

農業上での実際の使用に際し、式(I)の化合物はそのまま又は適当な組成物として使用することができる。

これらの化合物は、活性物質としての式(I)の化

11

の範囲である。

さらに、一般式(I)の化合物は、各種の使用分野において興味ある植物成長調整特性を有する。

たとえば、それらは花の定着を促進させ、すなわち何ら受粉なしに単為結実性果実の成育を生ぜしめる。この種の能力は一般にトマト及びこしよりの温室栽培における定着を促進させるために使用される。

その他の植物成長調整剤の利用は、接穂における根部成長を刺激することである。

式(I)の化合物に通ずる他の利用法は、特にりんごの木に関し収穫前における果実脱落を減少させることである。

式(I)の化合物により発揮される植物成長調整作用は、化合物及び必要とされる作用の種類に応じて程度が異なる。

しかしながら、この種類の範囲以内において数種の化合物は市販されている種々異なる化学種類の植物成長調整剤の一種と匹敵する植物成長調整活性を有することが証明されており、又二三の化合

13

物の1種若しくはそれ以上の他に、さらに固体もしくは液体のベヒクル及び必要に応じ表面活性剤、乳化剤及びその他の添加物を含有する。

所望ならば、組成物にはさらに肥料、植物成長調整剤及びその他の除草剤から選択される他の適する活性物質を添加することもできる。

除草剤組成物は慣用の農薬技術に従つて、粒剤、粉末、水和性粉末、乳化性濃厚物などとして配合することができる。

組成物の種類及び目的とする特定用途に応じて、活性物質は1〜99重量%の範囲の量で含有させることができる。

雑草に対し保護すべき領域に散布される組成物若しくは配合物の量は、種々の因子、たとえば組成物若しくは配合物の種類及びそこに含まれる特定活性物質のそれぞれの効果、感染の種類及びその程度、耕作物の種類、気候及び環境要因などに応じて変化する。

いずれにせよ、雑草に対し栽培物を充分保護するため散布される活性物質の量は0.3〜6 Kg/ha

12

物は特定の利用の種類を目的とする特定の市販化合物よりもずっと良好であることが証明された。

植物成長調整剤としての実用的用途において、式(I)の化合物は乳化性濃厚物としての形態で使用することができ、他の配合物はその特定用途のため実用的観点からほとんど興味がない。

乳化性濃厚物は、活性物質としての式(I)の一種もしくはそれ以上の化合物の他に、さらに適当な溶媒及び表面活性剤を含有する。所定量の水もこの濃厚物中に存在させることができる。

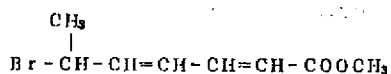
処理を行なうに際し、濃厚物は活性物質の所望濃度を得るまで水中に希釈され、その濃度は植付処理用としては約10〜200 mg/l、好ましくは約100 mg/lであり、果実脱落防止処理用には約1〜10 g/ha、好ましくは約3 g/haである。

以下の例により本発明をより詳細に説明する。

#### 例 1

式

14



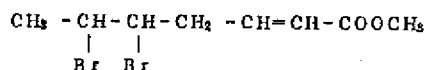
の6-ブロムヘプタ-2,4-ジエン酸メチルの製造。

100 mlのCCl<sub>4</sub>中の臭素5.0 g (0.318モル)の溶液を-15°Cにて攪拌下に維持された50 mlのCCl<sub>4</sub>中における2,5-ヘプタジエン酸メチル〔O・B・チユウソリーに従つて調整される(ラ・シミカ・エール・インダストリア、第41巻、第506頁、1959)〕4.46 g (0.318モル)の溶液に約2時間かけて滴加した。

この添加が完了した後、温度を自動的に室温まで上昇させた。

次いで、反応混合物を減圧下で蒸留し、100~105°Cかつ0.1 mm Hgの圧力にて、沸とうする留分を集めた。

かくして、式



15

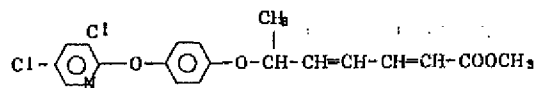
4.77 (m, 1H, H<sub>A</sub>)5.7-6.8 (m, 3H, H<sub>B</sub>+H<sub>C</sub>+H<sub>D</sub>)7.0-7.7 (m, 1H, H<sub>D</sub>)

〔s = シングレット、d = ダブルット、

m = マルチレット〕

## 例 2

式



の6-(3',5'-ジクロル-2'-ピリジノキシ)フェノキシヘプタ-2,4-ジエン酸メチルの製造。

磁気攪拌機を備えかつ窒素雰囲気下に保たれた100 mlのフラスコ中に次のものを導入した：

ナトリウム4-(3',5'-ジクロル-2'-ピリジノキシ)フェネート 3.2 g (0.0125ミリモル)及び6-ブロム-2,4-ヘプタジエン酸メチル 3.2 g (0.0146モル)及びメタノール 10 ml。

反応混合物を0°Cの温度にて2時間攪拌した。

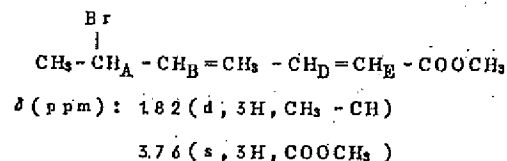
17

の5,6-ジブロムヘプタ-2-エン酸メチル 65.72 gを得た。次いで、このエステル6.34 g (0.21モル)を200 mlのメチルエチルケトン中に溶解させ、そして無水炭酸カリウム2.9 g (0.21モル)をこの溶液に加えた。

次いで、反応混合物を室温下に30時間加熱した。次いで、溶媒を減圧蒸発により冷時に除去した。この粗製生成物を再びエチルエーテルで希釈し、中性pHが得られるまで水で洗浄した。

エーテル溶液を次いで脱水しそして溶媒を減圧蒸発により除去した。次いで、この粗製生成物を高真空下で蒸留し、80°Cかつ0.1 mm Hgの圧力にて沸とうするフラクションを集めた。

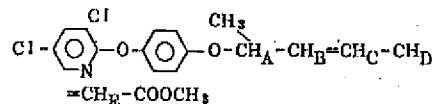
かくして、所望の生成物2.69 gが得られた。(元素分析及びIR分析は所定の構造に一致した) <sup>1</sup>H NMR(CDCl<sub>3</sub>, TMS)



16

次いでメタノールを室温で蒸発させ、残留物を再びエチルエーテルで希釈した。このエーテル溶液をソーダの希水溶液で洗浄し、次いで中性pHが得られるまで水洗した。

溶媒の蒸発により所望の生成物3.4 gが得られ、これを石油エーテルから結晶化させた(融点 = 100~103°C)

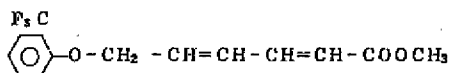
<sup>1</sup>H NMR(CDCl<sub>3</sub>, TMS)δ(ppm): 1.45 (d, 3H, CH-CH<sub>3</sub>)3.72 (s, 3H, COOCH<sub>3</sub>)4.85 (m, 1H, H<sub>A</sub>)5.64-6.62 (m, 3H, H<sub>C</sub>+H<sub>D</sub>+H<sub>E</sub>)6.7-8 (m, 7H, 芳香族プロトン+H<sub>B</sub>)

〔s = シングレット、d = ダブルット、

m = マルチレット〕

## 例 3

式



の6-(3-トリフルオロメチルフエノキシ)  
ヘキサ-2,4-ジエン酸メチルの製造。

還流凝縮器と磁気攪拌器とを備えかつ窒素雰囲気下に保たれた100mlのフラスコ中に次のものを導入した:

ナトリウム3-トリフルオロメチルフエネート  
3.6g(0.02モル)、6-ブロム-ヘキサ-2,  
4-ジエン酸メチル4.2g(0.02モル)及びメ  
タノール50ml。

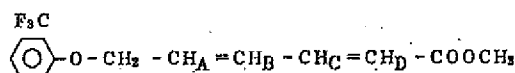
反応混合物を窒素雰囲気中で35℃の温度にて  
3時間攪拌した。

次いで、メタノールを蒸発させ、残留物を再び  
エチルエーテルで希釈した。このエーテル溶液を  
水洗し、無水 $\text{Na}_2\text{SO}_4$ 上で脱水した。次いで溶媒を  
蒸発させた。

残留物を高真空下で蒸留し、90℃かつ0.05  
mm Hgの圧力にて沸とうする留分を集めた。

かくして所望の生成物3.4gが得られた。

$^1\text{H}$  NMR( $\text{CDCl}_3$ , TMS)



$\delta$ (ppm): 3.8(s, 3H,  $\text{CH}_3$ )

4.8(d, 2H,  $\text{CH}_2$ )

5.9-6.8(m, 3H,  $\text{H}_B + \text{H}_C + \text{H}_D$ )

7-7.8(m, 5H,  $\text{H}_A$  + 芳香族プロトン)

{ s = シングレット、d = ダブルット、

m = マルチプレット }

#### 例 4

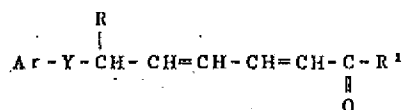
一般式(I)のいくつかの代表的化合物を以下の第  
1表に示す。

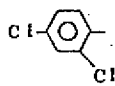
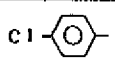
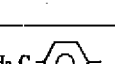
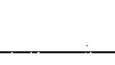
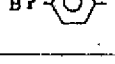
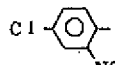
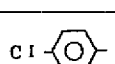
第1表の化合物は、例2又は例3に記載された  
と同様な方法で製造した。

$\text{R}^1 = \text{OH}$ である第1表の化合物は、 $\text{R}^1 = \text{OCH}_3$   
である対応する化合物から慣用技術に従う加水分解  
によつて製造した。

第1表

式(I)の化合物



化合物系	Ar	Y	R	$\text{R}^1$	室温における物理状態
1		O	H	$\text{OCH}_3$	固体(融点 $^{(2)}$ = 115℃)
2		O	H	$\text{OCH}_3$	固体(融点 = 67-68℃)
3		O	H	$\text{OCH}_3$	固体(融点 = 61-63℃)
4		O	H	$\text{OCH}_3$	固体(融点 = 72-74℃)
5		O	H	$\text{OCH}_3$	固体(融点 = 100℃)
6		O	H	$\text{OCH}_3$	固体(融点 = 100℃)
7		O	H	$\text{OCH}_3$	固体(融点 = 142℃)


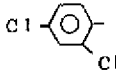
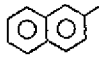
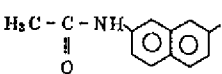
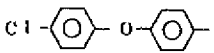
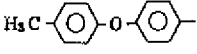
(3)		O	H	OCH <sub>3</sub>	液体 (沸点=90℃ 0.05mmHg)
9		O	H	OH	固体 (融点=110-115℃)
10		O	H	OH	固体 (融点=140-150℃、分解を伴う)
11		O	H	OCH <sub>3</sub>	固体 (融点=75-80℃)
12		S	H	OCH <sub>3</sub>	液体 (沸点=150-155℃、0.1mmHg)
13		S	H	OCH <sub>3</sub>	液体 (沸点=140-145℃、0.1mmHg)
14		O	H	OCH <sub>3</sub>	固体 (融点=62-64℃)
15		O	H	OCH <sub>3</sub>	固体 (融点=74-76℃)

22

16		O	H	OCH <sub>3</sub>	固体 (融点=100℃)
17		O	H	OCH <sub>3</sub>	固体 (融点=114℃)
18		O	H	OCH <sub>3</sub>	固体 (融点=50-55℃)
19		O	H	OCH <sub>3</sub>	固体 (融点=78℃)
20		O	H	OCH <sub>3</sub>	固体 (融点=55℃)
21		O	H	OH	固体 (融点=155-160℃)
22		O	H	OCH <sub>3</sub>	固体 (融点=155℃)
23		O	H	OCH <sub>3</sub>	固体 (融点=48-52℃)

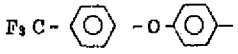
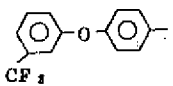
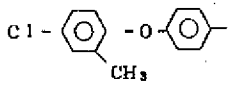
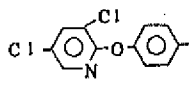
23

(第1表続き)

24		O	H	OCH <sub>3</sub>	固体 (融点=100-103℃)
25		O	H	OH	固体 (融点=105-110℃)
26		O	H	OCH <sub>3</sub>	固体 (融点=60-65℃)
27		O	H	OCH <sub>3</sub>	固体 (融点=162-166℃)
28		O	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	液体 <sup>(4)</sup> <sup>1</sup> H-NMR <sup>(5)</sup> (δ, ppm) 1.52 (d, 3H); 3.84 (s, 3H); 4.97 (m, 1H); 5.9-6.68 (m, 3H); 6.78-7.98 (m, 9H)
29		O	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	液体 <sup>(4)</sup> <sup>1</sup> H-NMR (δ, ppm) 1.42 (d, 3H); 2.23 (s, 3H); 3.65 (s, 3H); 4.95 (m, 1H); 5.6-6.3 (m, 3H); 6.5-7.4 (m, 9H)

24

(第1表続き)

30		O	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	液体 <sup>(4)</sup> <sup>1</sup> H-NMR (δ, ppm) 1.47 (d, 3H); 3.7 (s, 3H); 4.8 (m, 1H); 5.55-6.42 (m, 3H); 6.68-7.78 (m, 9H)
31		O	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	液体 <sup>(4)</sup> <sup>1</sup> H-NMR (δ, ppm) 1.48 (d, 3H); 3.76 (s, 3H); 4.91 (m, 1H); 5.77-6.66 (m, 3H); 6.77-7.66 (m, 9H)
32		O	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	液体 <sup>(4)</sup> <sup>1</sup> H-NMR (δ, ppm) 1.42 (d, 3H); 2.2 (s, 3H); 3.68 (s, 3H); 4.76 (m, 1H); 5.64-6.37 (m, 3H); 6.52-7.53 (m, 8H)
33 <sup>(d)</sup>		O	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	固体 (融点=100-103℃)

## 第1表に対する註

- (1) 各化合物の元素分析並びに I・R 及び N・M・R 分光分析データは所定の構造に一致した。
- (2) 第1表に示した融点は未補正のものとした。
- (3) 化合物 8 の製造は例3に記載されている。
- (4) この化合物は、蒸留前の加熱で分解する。
- (5) 第1表に示した <sup>1</sup>H-NMR スペクトルは、溶媒としての CDCl<sub>3</sub> と内部標準としての TMS とを使用して記録した、  
s = シングレット、d = ダブルット、  
m = マルチブレット。
- (6) 化合物 3 の製造は例2に記載されている。

## 例 5

除草活性の測定。

砂質土壌を含有するポットを調製し(頂部直径 = 10 cm、高さ = 10 cm)、各ポットには次の雑草の1種を播種した。

## 単子葉

- ケノボジウム・アルブム (Chenopodium album) (A)  
ルメックス・アセトセラ (Rumex acetosella) (B)  
ペロニカ・ベルシカ (Veronica persica) (C)

各ポットには、種子の良好な発芽を確保するのに必要な量の水を加えた。

これらポットを3つの組に分けた。

最初の組は除草剤で処理せず、比較として使用した。

第2の組は発芽前における除草活性を評価するため本発明の化合物のヒドロアセトン分散物(20容積%)により播種の1日後に処理した。

第3の組は、発芽後における除草活性を評価するため、本発明の化合物のヒドロアセトン分散物(20容積%)により播種の後15日目に処理した(すなわち植物は根類に応じてすでに高さ5~10 cmに達した)。

全てのポットを15~24℃の範囲の温度、70%の相対湿度、光周期12時間、光度2000ルクスの状態調節された環境下で観察した。

2日毎に、全てのポットに均一に散水したが、

- エチノクロア・クルスガリ (Echinochloa crusgalli) (A)  
アベナ・ファツア (Avena fatua) (B)  
アロベクルス・ミオスロイデス (Alopecurus myosuroides) (C)  
スルガム・スペシース (Sorghum spp.) (D)  
セタリヤ・グラウカ (Setaria glauca) (E)  
ジギタリヤ・サングイナリス (Digitalis sanguinalis) (F)  
パニクム・ジコトミフロム (Panichum dichotomiflorum) (G)  
フェスツカ・ブラテンシス (Festuca pratensis) (H)  
ブロムス・ステリリス (Bromus sterilis) (I)  
ロリウム・イタリクム (Lolium italicum) (J)  
ダクチリス・グロメラタ (Dactylis glomerata) (K)

## 双子葉

- ステラリア・メジア (Stellaria media) (L)  
イボメア・プルブレア (Ipomea purpurea) (M)  
ビグナ・シネンシス (Vigna sinensis) (N)  
コンボルボルス・セビウム (Convolvulus sepium) (O)  
ソラヌム・ニグルム (Solanum nigrum) (P)  
アマランthus・レトロフレックス (Amaranthus retroflexus) (Q)

この組合、植物の良好な発育に充分な程度の湿度を確保するよう、土壌のみを湿らすよう注意した。

処理してから28日後、植物の栄養増殖段階を測定し、対応する評価を尺度0(比較の成長に等しい成長)~4(植物の成長の完全な停止、すなわち死滅)にわたる数値に従って表記した。得られた結果を第2表及び第3表に示す。

## 第2表

指定した投与量における発芽前の除草活性。

化合物系 (第1表参照)	活性物質の 投与量 (kg/ha)	雑 草									
		A	C	D	E	F	H	I	J	M	N
2	6									3	
8	6									4	3
9	6									4	
10	6									4	
30	2	3	4	3	3	4	4	3	3		

30

第3表

指定投与量における発芽後の除草活性

化合物系 (第1表参照)	活性物質の投 与量 (kg/ha)	雑 草																	
		A	B	C	D	E	F	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	Q	R
1	6												2	4	4				
	1													4		4	4	4	
2	6												3	4	4				
	1													3		4	4	4	
4	6													4	4				
	1													3		4	2	4	
6	6	4											3	4	4				
	1													3		4	3	3	
8	6	3											4	4	4				
	1													4		4	2	4	
9	6	4											4	4	4				
	2													4	3	4			4
10	6												4	4	4				
	2												3	4		4			3
18	6												3	4					
28	2	4		4		4	3	4	4		4								
30	6	4	4																
	2	4	3	4	4	4	4	4	4	4	4	4							

## 例 6

発芽後における有用栽培物に対する選択性。

本発明の化合物を耕作物に対するそれらの植物毒性を決定するため試験した。

発芽後の処理につき例5に記載したと同様に操作して、植物毒性による被害を下記の有用植物につき評価した。

小麦	(A')
ビート	(B')
きうり	(C')
パセリ	(D')
セロリ	(E')
ういきよう	(F')
豆	(G')
トマト	(H')
にんじん	(I')

植物毒性による被害を除草活性に関する例5で使用したと同じ尺度の数値により表記し、この場合指標は0(比較の成長と等しい成長)~4(植物の成長の完全な停止すなわち死滅)の範囲とし

32

化合物系 (第1試験系)	根 維 肥 率								
	A'	B'	C'	D'	E'	F'	G'	H'	I'
	0	0	0	0	0	0	0	1	0
	0	0	0	0	0	0	0	0	0
	0	0	0	0	0	0	0	0	0
	0	0	0	0	0	0	0	0	0
	0	0	0	0	0	0	0	0	0
	0	0	0	0	0	0	0	0	0
	0	0	0	0	0	0	0	0	0
活性物質の 投与量 (g/ha)		4	4						
化合物系 (第1試験系)		28	30						

34

た。得られた結果を下記第4表に示す。

## 第4表

指定投与量における有用栽培物に対する植物毒性。

33

## 例 7

トマトに対する植付試験。

18~21℃の温度で温室内にて成育させたトマト植物、すなわちマルマンデ種を直径3.5cmのポットに移植した。

植物の成長期間中、吸枝を絶えず除去して植物に中央の茎のみ残した。

最初の花枝が開花期に3~4個の花を現出した時、湿潤剤と100ppmの濃度における被験化合物とを含有するヒドロアセトン溶液(アセトンの20容置%)を噴霧した。

処理を7日後に反復した。

第2回目の処理の12日後、果実を採取して秤量した。

比較の目的で、一組のトマト植物を同様にして栽培し、植物成長調整剤を含有しないヒドロアセトン溶液だけで処理した。

この試験の結果を果実の平均重量として表わして下記第5表に示す。

上記の結果は一般式(I)の化合物が定着活性を有

35

することを明確に証明している。

さらに、それらの活性は $\beta$ -ナフトキシ酢酸すなわち温室におけるトマトの植付に対し使用される市販の植物成長調整剤の1種に匹敵するものであり、又或る場合にはそれよりも優れている。

第5表

トマトの花の定着。

化合物系 (第1表参照)	果実の平均重量 (g)
1	40.42
2	52.86
9	48.02
18	41.87
23	50.19
26	41.53
$\beta$ -NOA (1)	45.37
比較	17.68 <sup>(2)</sup>

第5表に対する註：

- (1)  $\beta$ -NOA= $\beta$ -ナフトキシ酢酸、すなわち市販の植物成長調整剤。  
 (2) 17.62g=植物成長調整剤で処理しなかつ

36

第6表

りんご樹の葉に対する脱落防止活性。

化合物系 (第1表参照)	脱落葉-葉の割合 (%)
1	0
6	6.4
9	25.6
23	14.3
比較	67.5

代理人の氏名

倉内基弘



同

倉内基



た植物の果実の平均重量。

## 例 8

脱落防止活性の試験。

ポット中で栽培しかつ温室内で生育させたりんと植物に30 ppmの濃度で被験化合物を含有するヒドロアセトン分散物(アセトン中の20容積%分散物)を噴霧した。

処理してから3日後、各樹木につき20枚の葉を切除して、枝についた茎のみを残した。

処理してからさらに11日後、脱落する茎の割合を手による僅かな圧力をかけることにより評価した。

比較のため、植物成長調整剤を含有しないヒドロアセトン溶液のみで処理したりんと植物について、同様な試験を行なった。

試験の結果を脱落した茎の割合として表わして下記第6表に示す。

37

## 第1頁の続き

①Int. Cl.<sup>3</sup>

識別記号

庁内整理番号

C 07 C 69/736

6556-4H

103/178

7375-4H

103/22

7375-4H

103/26

7375-4H

103/58

7375-4H

153/023

7142-4H

C 07 D 213/64

7138-4C

215/28

6675-4C

②発明者 チロ・プレツイウソ

イタリア国ミラノ・ピア・ベサ  
リオネ29

③発明者 エレナ・ベンチニ

イタリア国ノバラ・コルソ・ベ  
ンテイトレ・マルツオ170

④発明者 エルネスト・シニヨリニ

イタリア国バレセ・マルナテ・  
ピア・マテオティ51

⑤発明者 ジョルジョ・シデイ

イタリア国ミラノ・エツセ・ド  
ナト・ミラネセ・ピア・エウロ  
バ4

⑫発 明 者 ジャンピエロ・サパリノ  
イタリア国ベルチエリ・ピア・  
フロバ9

